

**NOTIFICATION OF REASONS FOR REFUSAL**

Application Number	JP-2004-549617
Drafting Date	April 7, 2010
Examiner	Toshio SUZUKI 4150 4P00
Attorney of Applicant	Mr. Mitsuo KUWATA
Applicable Articles	Section 29(2) and Section 36

This application is refused for the reasons indicated below. The applicant may submit a written argument if necessary, within 60 days from the mailing date of this notification.

**REASONS**

1. The claimed invention of this application, indicated below, is an invention that could easily have been made, prior to the filing of the application, by a person with ordinary skill in the art to which the invention pertains, on the basis of an invention that was described in the following distributed publications or made available to public through electric telecommunication lines in Japan or elsewhere; and thus, in accordance with the provision prescribed in Patent Law Section 29(2), may not be patented.
2. Claim(s) of this application fails to comply with the requirement prescribed in Patent Law Section 36(6)(ii), with respect to the points indicated below.

**NOTE**

(Cited references are listed in the section  
"LIST OF CITED REFERENCES")

- Reason 1
- Claims 1 to 9
- Cited reference 1
- Comments

Cited reference 1 discloses that the compound of the formula (I), which is similar to the compound of the present invention in chemical structure, has an anti-inflammatory action and a bronchodilator action (see Claim 1, Examples, and Test Examples).

When comparing the compound specified in claim 1 of this application with the compound of the above-mentioned formula (I) of the cited reference, these compounds are different from each other in the following respect: the former compound has a group represented by  $(CH_2)_m\text{-A}$  on 3-position of the pyrazolonaphthyridine skeleton; whereas in the latter compound, there is no description about a group represented by  $(CH_2)_m\text{-A}$  as  $R^2$  on the same position. Therefore, this respect is examined.

First, a skilled person who came in contact with Cited reference 1 would understand that the compound of the formula (I) has an anti-inflammatory action and a bronchodilator action independent of the group  $R^2$  on the basis of Examples and test examples described in the reference.

Secondly, a skilled person engaged in search and studies ordinarily conducts replacement of a group of a known compound having a pharmacological action by a variety of groups to provide new pharmaceutical compounds. Moreover, when a compound having an anti-inflammatory action or a bronchodilator action was examined, the group represented by  $(CH_2)_m\text{-A}$  as a substituent was well known in the art prior to the priority date of this application (in brief, see Cited reference 2: Claim 1, [0001], and Examples 39 and 140, Cited reference 3: Claim 1, [0034], and Examples 7, 15 to 17, Cited reference 4: Claim 1, page 48, lines 8 to 21,

and Examples, Cited reference 5: Claims 1 and 11, and Compounds 22 and 23, Cited reference 6: Claims 1, 3, and 21, and Examples, and Cited reference 7: Claims 1 and 11, and Examples 21 to 22, 64 to 68, 79 to 80, and 84).

Therefore, for the purpose of providing a new compound having an anti-inflammatory action and a bronchodilator action, a person with ordinary skill in the art could easily be motivated to substitute a variety of groups for the group R<sup>2</sup> of the compound of the formula (I) described in Cited reference 1 and to use the group represented by (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-A as an embodiment thereof.

[2]

Reason 2

Claim 7

Although Claim 7 discloses "diseases directly or indirectly related to phosphodiesterase IV", it is unclear what diseases the phrase specifically means.

#### LIST OF CITED REFERENCES

1. JP-5-194515A
2. JP-2000-119271A
3. JP-2002-528549A
4. JP-2000-502699A
5. JP-2001-512121A
6. International Publication No. 01/42244
7. International Publication No. 96/06843

---

#### RECORD OF SEARCH FOR PRIOR ART REFERENCES

Searched art

IPC A61K 31/33-33/44

Reference Number:  
Mailing Number: 253621 Mailing Date: April 13, 2010

C07D471/14

DB name CAPLUS, REGISTRY (regarding the  
above, STN)

This record of search for prior art references does not  
constitute reasons for refusal.

Please contact the examiner at the following telephone  
number or fax number when you would like to inquire or to have  
an interview concerning the content of this notification of ground  
for rejection.

Third Patent Examination Department,  
Medical Treatment (Pharmaceutical Compound)  
Examiner Toshio SUZUKI  
TEL. 03(3581)1101 extension 3490  
FAX. 03(3581)1342

## 拒絶理由通知書

期限 2010年 6月 12日



特許出願の番号	特願 2004-549617		
起案日	平成22年 4月 7日		
特許庁審査官	鈴木 智雄	4150	4P00
特許出願人代理人	鍬田 充生 様		
適用条文	第29条第2項、第36条		

この出願は、次の理由によって拒絶をすべきものです。これについて意見がありましたら、この通知書の発送の日から60日以内に意見書を提出してください。

## ( 理由

1. この出願の下記の請求項に係る発明は、その出願前に日本国内又は外国において、頒布された下記の刊行物に記載された発明又は電気通信回線を通じて公衆に利用可能となった発明に基いて、その出願前にその発明の属する技術の分野における通常の知識を有する者が容易に発明をすることができたものであるから、特許法第29条第2項の規定により特許を受けることができない。

2. この出願は、特許請求の範囲の記載が下記の点で、特許法第36条第6項第2号に規定する要件を満たしていない。

( 記 (引用文献等については引用文献等一覧参照)

〔1〕

- ・理由 1
- ・請求項 1～9
- ・引用文献 1
- ・備考

引用文献1には、本願発明の化合物に化学構造が類似する、式(I)の化合物が抗炎症作用、気管支拡張作用を有することが記載されている(請求項1、実施例、試験例を参照)。

本願請求項1で規定する化合物と引用文献に記載の上記式(I)の化合物を対比すると、前者はピラゾロナフチリジン骨格の3位に(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-Aで表される基を有するのに対し、後者は同位置のR<sup>2</sup>として(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-Aで表される基が記載されていない点で相違するのでこの点について検討する。

まず、引用文献1に接した当業者は、同文献の実施例及び試験例の記載から、上記式(I)の化合物が上記R<sup>2</sup>の基に因らず抗炎症作用及び気管支拡張作用を有することを理解する。

次に、薬理作用を有する既知の化合物の基を種々置換して、新しい医薬化合物を提供することは、探索研究に従事する当業者が通常行うことであり、そして、抗炎症作用や気管支拡張作用を有する化合物を検討する際の置換基として、(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-Aで表される基は、本願優先日前の当業者にとり周知のものである(要すれば、引用文献2:請求項1、【0001】、実施例39、140、引用文献3:請求項1、【0034】、実施例7、15~17、引用文献4:請求項1、第48頁第8行~21行、実施例、引用文献5:請求項1、11、化合物22、23、引用文献6:請求項1、3、21、実施例、引用文献7:請求項1、11、実施例21~22、64~68、79~80、84を参照)。

してみると、新しい抗炎症作用、気管支拡張作用を有する化合物を提供する目的で、引用文献1の上記式(I)の化合物におけるR<sup>2</sup>の基を種々の基で置換してみると、その一様として(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-Aで表される基を用いることは、当業者が容易に想到し得たことである。

## [2]

- ・理由 2
- ・請求項 7

請求項7には、「ホスホジエステラーゼIVが直接的または間接的に関与する疾患」と記載されているが、これが具体的に如何なる疾患を意味するのかが不明確である。

## 引用文献等一覧

- 1.特開平5-194515号公報 ✓
- 2.特開2000-119271号公報
- 3.特表2002-528549号公報 ✓
- 4.特表2000-502699号公報 ✓
- 5.特表2001-512121号公報 ✓
- 6.国際公開第01/42244号 ✓
- 7.国際公開第96/06843号

## 先行技術文献調査結果の記録

・調査した分野 I P C A 6 1 K 3 1 / 3 3 - 3 3 / 4 4  
C 0 7 D 4 7 1 / 1 4

整理番号: 発送番号:253621 発送日:平成22年 4月13日 3/E

DB名 CAPLUS、REGISTRY(以上、STN)

この先行技術文献調査結果の記録は拒絶理由を構成するものではありません。

この拒絶理由通知の内容に関するお問い合わせ、または面接のご希望がございましたら下記までご連絡下さい。

特許審査第三部 医療(医薬化合物) 審査官 鈴木智雄(としお)

TEL. 03(3581)1101 内線3490

FAX. 03(3581)1342